

▼ジレニア カプセル, ▼イムセラ カプセル [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】フィンゴリモド塩酸塩 Fingolimod Hydrochloride 【分類】多発性硬化症治療剤

【単位】▼0.5mg/Cap

【常用量】0.5mg/日

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】設定されていないが、慎重投与 (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr 30mL/min 未満の腎障害患者では健常人に比べ未変化体の Cmax が 32%、AUC が 43%増加 [t1/2 は変化なし]、リン酸化体の Cmax が 25%、AUC が 14%増加 [t1/2 は変化なし] (1) 不活性代謝物 M2 (カルボン酸代謝物) の Cmax は 3 倍以上、不活性代謝物 M3 (カルボン酸代謝物) の Cmax 及び AUC はそれぞれ 8 倍及び 14 倍に増加 (1) よって、慎重投与 (5)

【特徴】多発性硬化症の再発予防及び身体的障害の進行抑制に使用される。活性代謝物のリン酸化体は、スフィンゴシン 1-リン酸 (S1P) 受容体 1 (S1P1 受容体) と結合し、その内在化と分解を誘導することで、S1P1 受容体の機能的アンタゴニストとして作用するため、リンパ節などの二次リンパ組織からのリンパ球の移出を抑制する。ミエリン抗原特異的な Th17 細胞を含む自己反応性 T 細胞も、同様の機序でリンパ節からの移出が抑制されるため、中枢神経系組織への浸潤が抑制される。ただし免疫に働くエフェクターメモリー T 細胞に対しほとんど影響しない。感染症へのリスクが高まるので予防が必要。

【主な副作用・毒性】感染症、鼻咽頭炎、肝機能検査値異常、徐脈性不整脈、白血球減少、リンパ球減少、血小板減少、進行性多巣性白質脳症 (PML)、頭痛など多数

【安全性に関する情報】投与初期の徐脈に注意 (1)

【F】93% (1) 90%以上で食事の影響を受けない (David OJ, et al: Clin Pharmacokinetics 51:15-28, 2012)

【tmax】16hr (1)

【代謝】CYP4F サブファミリーで代謝され、特に CYP4F2 の寄与が大きい (1) 薬理学的に活性を有するフィンゴリモドリン酸化体 (S) -エナンチオマーへの可逆的なリン酸化、主に CYP4F2 を介する酸化代謝及びその後の脂肪酸β酸化様の分解、及び非樹性セラミド類似体の生成により代謝される (1)

【排泄】尿中回収率約 81% (1) 活性体としては排泄されない (1)

【CL】6.3±2.3L/hr (1)

【t1/2】5.8~7.6 日 (1) 6~9 日で定常状態まで 1~2 か月 (David OJ, et al: Clin Pharmacokinetics 51:15-28, 2012)

【蛋白結合率】未変化体、リン酸化体ともに 99.7%以上 (1)

【Vd】血球移行率 87% (1) リン酸化体の血球移行率 18% (1) 1199±260L/man [iv] (1)

【MW】343.93

【透析性】透析されない (1) HD による血中濃度低下率 14% (1)

【O/W 係数】22.26 [1-オクタノール/水系] (1)

【相互作用】生ワクチンの使用禁忌 (1) クラス Ia, III の抗不整脈薬との併用禁忌 (1) β-blocker 併用による徐脈の増強に注意 (1) CYP4F2 で代謝される薬剤が少なく、他の CYP を阻害しないため代謝の面での相互作用は起きにくいと思われる (David OJ, et al: Clin Pharmacokinetics 51:15-28, 2012)

【妊婦・授乳婦に関する情報】妊婦に禁忌 (1)

【更新日】20220402

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院ではいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。